

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 8 月 18 日 (18.08.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/075431 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 217/24, A61K 31/472, 31/496,
31/5377, A61P 35/00, 43/00, C07D 401/04

Miyuki) [JP/JP]; 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原 2 0 0
中外製薬株式会社内 Kanagawa (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/001764

(74) 代理人: 社本 一夫, 外(SHAMOTO, Ichio et al.); 〒
1000004 東京都千代田区大手町二丁目 2 番 1 号 新大
手町ビル 2 0 6 区 ユアサハラ法律特許事務所 Tokyo
(JP).

(22) 国際出願日: 2005 年 2 月 7 日 (07.02.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2004-030885 2004 年 2 月 6 日 (06.02.2004) JP

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 中
外製薬株式会社 (CHUGAI SEIYAKU KABUSHIKI
KAISHA) [JP/JP]; 〒1158543 東京都北区浮間 5 丁目
5 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 服部 一夫 (HAT-
TORI, Kazuo) [JP/JP]; 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶
原 2 0 0 中外製薬株式会社内 Kanagawa (JP). 新妻
諭 (NIUZUMA, Satoshi) [JP/JP]; 〒2478530 神奈川県
鎌倉市梶原 2 0 0 中外製薬株式会社内 Kanagawa
(JP). 岡田 剛宏 (OKADA, Takehiro) [JP/JP]; 〒2478530
神奈川県鎌倉市梶原 2 0 0 中外製薬株式会社内
Kanagawa (JP). 江田 浩幸 (EDA, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒
2478530 神奈川県鎌倉市梶原 2 0 0 中外製薬株式
会社内 Kanagawa (JP). 辰野 健二 (TATSUNO, Kenji)
[JP/JP]; 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原 2 0 0 中外
製薬株式会社内 Kanagawa (JP). 吉田 美幸 (YOSHIDA,

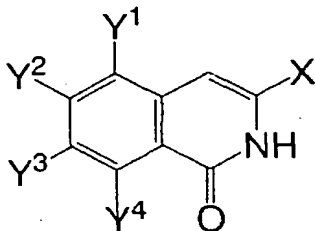
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: 1-(2H)-ISOQUINOLONE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 1-(2H)-イソキノロン誘導体



(1)

(57) Abstract: Disclosed is a compound represented by the for-
mula (1) below, a prodrug thereof or their pharmacologically
acceptable salt. Also disclosed is a medical drug or medical
drug composition containing the compound. (1) [In the formula,
Y¹ and Y⁴ respectively represent a hydrogen atom or a halogen
atom; one of Y² and Y³ represents -NR¹R² and the other repre-
sents a hydrogen atom or a halogen atom; X represents an op-
tionally substituted aryl group or heteroaryl group; R¹ represents
a hydrogen atom or an optionally substituted C₁₋₈ alkyl group;
R² represents a C₁₋₈ alkyl group substituted by one or more sub-

stituents, -COOR³, -COR⁴, -COSR⁵, -CONR⁶R⁷, -NR²²R²³ or -C=NR²⁴R²⁵; and R¹ and R² may combine with a nitrogen atom bonded
thereto to form a 4-10 membered heterocyclic ring containing at least one nitrogen atom (and this heterocyclic ring may be substi-
tuted by one or more substituents selected from group C).]

[続葉有]

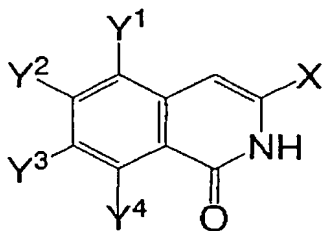
WO 2005/075431 A1



(57) 要約:

本発明により、式(I)

【化1】



(1)

[式中、 Y^1 および Y^4 は、水素原子またはハロゲン原子であり; Y^2 および Y^3 のどちらか一方は-N R^1R^2 であり、他方は水素原子またはハロゲン原子であり; X は、置換されていてもよいアリール基またはヘテロアリール基であり; R^1 は、水素原子または置換されていてもよい C_{1-8} アルキル基であり; R^2 は、1またはそれ以上の置換基により置換された C_{1-8} アルキル基、 $-COOR^3$ 、 $-COR^4$ 、 $-COSR^5$ 、 $-CONR^6R^7$ 、 $-NR^{22}R^{23}$ または $-C=NR^{24}R^{25}$ であり;または、 R^1 および R^2 は結合する窒素原子と一緒に、少なくとも窒素原子を一つ含む4-10員ヘテロ環(当該ヘテロ環はC群から選択される1またはそれ以上の置換基により置換されていてもよい)を形成していてもよい]

の化合物またはそのプロドラッグ、もしくはそれらの製薬上許容されうる塩、ならびに当該化合物を含む医薬、医薬組成物などが提供される。